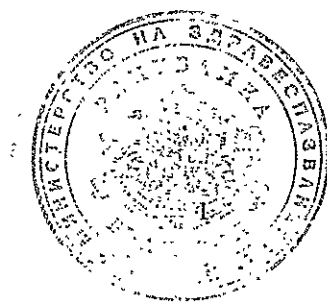


EFFORTIL®

таблетки

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА



1. Име на лекарствения продукт:

Effortil таблетки

/Ефортил/

2. Състав:

1 таблетка съдържа 5 mg

2-етиламино-1-(3-хидроксифенил) етанол хидрохлорид (= етилефрин

хидрохлорид).

3. Лекарствена форма:

Таблетки

4. Клинични данни:**4.1. Показания:**

Симптоматична или ортостатична хипотония, която не протича с пристъпни високочестотни ритъмни нарушения.

4.2. Дозировка и начин на приложение:

Трябва да бъдат следвани следните препоръчителни дози:

Възрастни и деца над 6 год.: 1-2 таблетки 3 пъти дневно**Деца между 2 и 6 години:** ½-1 таблетка 3 пъти дневно

Effortil таблетки трябва да бъдат приемани с течност. Особено бърз ефект се постига ако таблетките се приемат преди хранене.

4.3. Противопоказания:

Effortil е противопоказан при пациенти, които са свръхчувствителни към етилефрин или към някое от използваните помощни вещества.

Както и при другите симпатикомиметици, Effortil не трябва да се прилага при пациенти с тиреотоксикоза, феохромоцитом, тесноъгълна глаукома, хипертрофия на простатата с ретенция на урина, хипертония, коронарно сърдечно заболяване и хипертрофична обструктивна кардиомиопатия.

Effortil не трябва да се използва през първите три месеца на бременността, както и по време на кърмене.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба:

Преди започване на лечение с Effortil, като причина за хипотонията трябва да бъдат изключени стеноза на сърдечните клапи или централните артерии.

При пациенти с тахикардия, сърдечни аритмии или тежки кардиоваскуларни нарушения е необходимо внимателно приложение на препарата.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия:Ефектите на Effortil могат да бъдат засилени при едновременно приложение на гванетидин, минералокортикоиди, симпатикомиметици или всякакви субстанции със симпатикомиметична активност (като трициклични антидепресанти, MAO-инхибитори). Халогенираните алифатни въглеводороди могат да засилят ефектите на симпатикомиметичните средства върху сърцето и това да доведе до развитие на сърдечни аритмии. Адренергичните блокери (α -блокери и β -блокери) могат частично или изцяло да отстранят действието на етилефрина.**4.6. Бременност и кърмене:**

През втория и трети триместър на бременността Effortil трябва да се използва само след внимателна преценка на рисковете и ползата от лечението. Препаратът не трябва да се използва през първите три месеца на бременността.

Effortil може да наруши утероплацентарната перфузия и да предизвика маточна релаксация. Не може да се изключи преминаване на лекарството в майчиното мляко, поради това Effortil не трябва да се приема по време на кърмене.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини:

Не са извесни.

4.8. Нежелани лекарствени реакции:

Рядко могат да възникнат палпитации, тахикардия, тревожност, изпотяване, безсъние, гадене, тремор и усещане за напрежение в главата. При пациенти с нарушена чувствителност не могат да бъдат изключени ангинозни болки, сърдечни аритмии и нежелани повишавания на кръвното налягане. При пациенти с такива симптоми дозата на Effortil трябва да бъде намалена.

Таблетките съдържат натриев пиросулфит, към когото могат да бъдат наблюдавани реакции на свръхчувствителност.

4.9. Предозиране:

Симптоми

Острото предозиране засилва по-горе описаните нежелани лекарствени реакции. При новородени и малки деца предозирането може да предизвика централна респираторна депресия и кома.

Лечение

Трябва да бъде приложено обичайното симптоматично лечение. В случай на тежко предозиране трябва да бъде предприето интензивно лечение.

Симптоми, които се дължат на бета₁-симпатомиметична активност, могат да бъдат третирани с бета-блокери, приложени съгласно указанията за тази терапевтична група медикаменти.

5. Фармакологични данни:

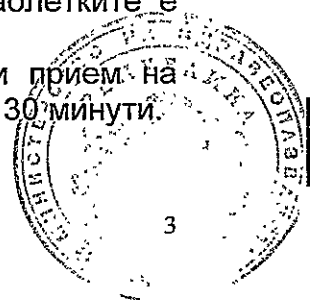
5.1. Фармакодинамични свойства:

Етилефрин, активната съставка на Effortil е директно действащо симпатикомиметично средство, което притежава висок афинитет към α_1 , β_1 и към β_2 -рецепторите. В резултат на това се засилва контрактилитета на миокарда и се увеличава ударния обем. В допълнение на това се повишават венозния тонус и централното венозно налягане, което води до увеличаване на обема на циркулиращата кръв. При пациенти с нормална сърдечна дейност е наблюдаван позитивен инотропен ефект. Лекарството повишава систолното налягане в по-голяма степен, отколкото диастолното налягане. Приложението на продукта може да подобри субективните симптоми с функционален съдов произход (като замайване, умора и нерешителност), както и да стабилизира хемодинамичните параметри.

5.2. Фармакокинетични свойства:

В резултат на ефекта на първо преминаване, бионаличността на таблетките е около 12%.

Около 25% от лекарството се свързва с плазмените протеини. При прием на таблетките пиковите плазмени концентрации се наблюдават след около 30 минути.



При прием на радио-белязана субстанция при плъхове не е установено преминаване през кръвно-мозъчната бариера.

Все още не е известно дали етилефрин преминава през плацентарната бариера и дали се появява в майчиното мляко.

Етилефрин първично се елиминира с метаболизиране. Основният метаболит е конюгат на сярна киселина. Няма данни за активност на някои от метаболитите.

Времето на полуелиминиране е около 2 часа. След приложение на етилефрин, белязан с тритий, 75-80% от общата радиоактивност е открита в урината. Тъй като етилефрин и неговите конюгати се екскретират главно чрез бъбреците, при пациенти с бъбречни нарушения е възможно конюгатите да се натрупват там.

5.3. Предклинични данни за безопасност:

При проучвания с перорална единична доза при мишки, плъхове, зайци и кучета LD₅₀ е била между 66,4 mg/kg (плъхове) и 2,300 mg/kg (мишки). След и.в. приложение при мишки, зайци и кучета съответно стойностите са били между 6,8 и 16,7 mg/kg. Основните симптоми на токсичност са били пиломоторна бръксия, екзофтальм, цианоза, тахипнеа, саливация, атаксия, конвулсии (грязачи) и в някои случаи мидриаза, тремор и повръщане (при кучета). При подкожно приложение LD₅₀ при грязачи е била в порядъка от 200 до 300 mg/kg.

При перорално приложение до 26 седмици "нивото, до което не се наблюдават нежелани лекарствени реакции" (NOAEL) е било 3 mg/kg при плъхове и 0,6 mg/kg при кучета. При по-високи дози (3 или 6 mg/kg при плъх или респективно при куче) са били наблюдавани понижаване на сърдечната дейност и глюкозата в кръвта (плъх) или повишено кръвно и вътреочно налягане, мидриаза и повишена активност на SGPT (ALT). Както при кучета, така и при плъхове фиброзните промени в миокарда и митралните клапи са били наблюдавани при дози 6-30 mg/kg. При кучета допълнително са били наблюдавани повишено тегло на сърцето и хиперплазия на медиата на малките артерии. Във всички тези проучвания до 26 седмици не е имало данни за туморогенен потенциал на съединението. Не са били проведени проучвания за карциногенност ин виво до края на живота.

При 4 седмично и. в. приложение при кучета нивото, при което не се наблюдават нежелани лекарствени реакции е било 0,625 mg/kg. При 3,1 mg/kg се получава повръщане, намалено телесно тегло и е наблюдавано повишаване на серумната алкална фосфатаза (AP).

При мишки, плъхове и зайци перорална доза от 15 mg/kg p.o. не довежда до ембриолетални и тератогенни ефекти. При дози, токсични за майката (> 30 mg/kg p.o.) е било наблюдавано забавяне в развитието на фетусите на плъхове и мишки. По-чести са случаите на малформации. Преценено е, че тези ефекти са резултат на нарушено хранене на плода поради много силните фармакодинамични ефекти върху утеринните съдове.

6. Фармацевтични данни:

6.1. Помощни вещества:

Lactose	31,8000 mg
Maize starch	42,0000 mg
Aerosil 200	1,5000 mg
Starch soluble 5590 M.	3,0000 mg
Sodium pyrosulfite	0,5000 mg
Boeson VP	1,2000 mg

6.2. Физико-химични несъвместимости:

Не са известни.



6.3. Срок на годност:

Срокът на годност на Effortil таблетки е 5 години от датата на производство.

6.4. Условия за съхранение:

Да се съхранява на сигурно място извън достъпа на деца!

Да се съхранява при температура под 30⁰ С.

6.5. Опаковка:

PVC флакон

6.6. Препоръки при употреба:

Виж т. 4.2.

7. Производител:

Boehringer Ingelheim Pharma KG

Binger Strasse 173

D-55216 Ingelheim am Rhein

Germany

собственост на Boehringer Ingelheim International GmbH

8. Притежател на разрешението за употреба:

Boehringer Ingelheim International GmbH

Binger Strasse 173

D-55216 Ingelheim am Rhein

Germany

